1=

```
T S1/7
  1/7/1
DIALOG(R) File 351: Derwent WPI
(c) 2004 Thomson Derwent. All rts. reserv.
010142924
WPI Acc No: 1995-044175/199507
Cosmetic deodorant compsns. - contg. alpha, omega-alkanedioic acids.
Patent Assignee: BEIERSDORF AG (BEIE )
Inventor: KLIER M; ROECKL M; TRAUPE B; WOLF F
Number of Countries: 001 Number of Patents: 001
Patent Family:
Patent No Kind
                    Date
                            Applicat No
                                          Kind Date
                                                         Week
DE 4321753
            A1 19950112 DE 4321753
                                               19930630 199507 B
                                          Α
Priority Applications (No Type Date): DE 4321753 A 19930630
Patent Details:
Patent No Kind Lan Pg Main IPC
                                    Filing Notes
DE 4321753
            A1
                8 A61K-007/32
Abstract (Basic): DE 4321753 A
       Cosmetic deodorant compsns. contain one or more
   alpha-omega-alkanedioic acids (I), provided that (I) are not in the
    form of salts with aminated cpds.(cf. DE2703642).
       Dwg.0/0
Derwent Class: D21; E16
International Patent Class (Main): A61K-007/32
```

•				
1,				
			•	•
			*	
		/		
4,				



BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND

⁽¹⁾ Offenlegungsschrift

® DE 43 21 753 A 1

(5) Int. Cl.⁶: A 61 K 7/32



DEUTSCHES PATENTAMT

② Aktenzeichen:

P 43 21 753.2

2 Anm Id tag:

30. 6.93

Offenlegungstag:

12. 1.95

(1) Anmelder:

Beiersdorf AG, 20253 Hamburg, DE

(72) Erfinder:

Klier, Manfred, Dr., 21521 Aumühle, DE; Traupe, Bernd, 22457 Hamburg, DE; Wolf, Florian, Dr., 20251 Hamburg, DE; Röckl, Manfred, 22880 Wedel, DE

Prüfungsantrag gem. § 44 PatG ist gestellt

- (A) Desodorierende Kosmetika mit einem Gehalt an alpha-omega-Alkandicarbonsäuren
- \mathfrak{F} Kosmetische Desodorantien, enthaltend eine oder mehrere α, Ω -Alkandicarbonsäuren, wobei die α, Ω -Alkandicarbonsäuren nicht in Form der Salze einer aminierten Verbindung vorliegen.

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft desodorierende Kosmetika sowie desodorierende Wirkstoffe als Bestandteile kosmetischer Desodorantien.

Kosmetische Desodorantien dienen dazu, Körpergeruch zu beseitigen, der entsteht, wenn der an sich geruchlose frische Schweiß durch Mikroorganismen zersetzt wird. Den üblichen kosmetischen Desodorantien liegen unterschiedliche Wirkprinzipien zugrunde.

In sogenannten Antitranspirantien kann durch Adstringentien – vorwiegend Aluminiumsalze wie Aluminiumhydroxychlorid (Aluchlorhydrat) – die Entstehung des Schweißes unterbunden werden. Abgesehen von der Denaturierung der Hautproteine greifen die dafür verwendeten Stoffe aber, abhängig von ihrer Dosierung, drastisch in den Wärmehaushalt der Achselregion ein und sollten allenfalls in Ausnahmefällen angewandt werden.

Durch die Verwendung antimikrobieller Stoffe in kosmetischen Desodorantien kann die Bakterienflora auf der Haut reduziert werden. Dabei sollten im Idealfalle nur die Geruch verursachenden Mikroorganismen wirksam reduziert werden. In der Praxis hat sich aber herausgestellt, daß die gesamte Mikroflora der Haut beeinträchtigt werden kann.

Der Schweißfluß selbst wird dadurch nicht beeinflußt, im Idealfalle wird nur die mikrobielle Zersetzung des Schweißes zeitweilig gestoppt.

Auch die Kombination von Adstringentien mit antimikrobiell wirksamen Stoffen in ein und derselben Zusammensetzung ist gebräuchlich. Die Nachteile beider Wirkstoffklassen lassen sich auf diesem Wege jedoch nicht vollständig beseitigen.

Schließlich kann Körpergeruch auch durch Duftstoffe überdeckt werden, eine Methode, die am wenigsten den ästhetischen Bedürfnissen des Verbrauchers gerecht wird, da die Mischung aus Körpergeruch und Parfümduft eher unangenehm riecht.

Allerdings werden die meisten kosmetischen Desodorantien, wie die meisten Kosmetika insgesamt, parfümiert, selbst wenn sie desodorierende Wirkstoffe beinhalten. Parfümierung kann auch dazu dienen, die Verbraucherakzeptanz eines kosmetischen Produktes zu erhöhen oder einem Produkt ein bestimmtes Flair zu geben.

Die Parfümierung wirkstoffhaltiger kosmetischer Zubereitungen, insbesondere kosmetischer Desodorantien, ist allerdings nicht selten problematisch, weil Wirkstoffe und Parfümbestandteile gelegentlich miteinander reagieren und einander unwirksam machen können.

Desodorantien sollen folgende Bedingungen erfüllen:

1) Sie sollen eine zuverlässige Desodorierung bewirken.

- 2) Die natürlichen biologischen Vorgänge der Haut dürfen nicht durch die Desodorantien beeinträchtigt werden.
- 3) Die Desodorantien müssen bei Überdosierung oder sonstiger nicht bestimmungsgemäßer Anwendung unschädlich sein.
- 4) Sie sollen sich nach wiederholter Anwendung nicht auf der Haut anreichern.
- 5) Sie sollen sich gut in übliche kosmetische Formulierungen einarbeiten lassen.

Bekannt und gebräuchlich sind sowohl flüssige Desodorantien, beispielsweise Aerosolsprays, Roll-ons und dergleichen als auch feste Zubereitungen, beispielsweise Deo-Stifte ("Sticks"), Puder, Pudersprays, Intimreinigungsmittel usw.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es also, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, die die Nachteile des Standes der Technik nicht aufweisen. Insbesondere sollten die Desodorantien die Mikroflora der Haut weitgehend schonen, die Zahl der Mikroorganismen aber, die für den Körpergeruch verantwortlich sind, selektiv reduzieren.

Weiterhin war es eine Aufgabe der Erfindung, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, die sich durch gute Hautverträglichkeit auszeichnen. Auf keinen Fall sollten die desodorierenden Wirkprinzipien sich auf der Haut anreichern.

Eine weitere Aufgabe war, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, welche mit einer möglichst großen Vielzahl an üblichen kosmetischen Hilfs- und Zusatzstoffen harmonieren, insbesondere mit den gerade in desodorierend oder antitranspirierend wirkenden Formulierungen bedeutenden Parfümbestandteilen.

Noch eine weitere Aufgabe der Erfindung war, kosmetische Desodorantien zur Verfügung zu stellen, welche über einen längeren Zeitraum, und zwar in der Größenordnung von mindestens einem halben Tag, wirksam sind, ohne daß ihre Wirkung spürbar nachläßt.

Schließlich war eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung, desodorierende kosmetische Prinzipien zu entwikkeln, die möglichst universell in die verschiedensten Darreichungsformen kosmetischer Desodorantien eingearbeitet werden können, ohne auf eine oder wenige spezielle Darreichungsformen festgelegt zu sein.

Es wurde überraschenderweise gefunden, und darin liegt die Lösung all dieser Aufgaben, daß kosmetische Desodorantien, enthaltend eine oder mehrere $\alpha\Omega$ -Alkandicarbonsäuren, wobei die $\alpha\Omega$ -Alkandicarbonsäure oder die $\alpha\Omega$ -Alkandicarbonsäuren nicht in Form der Salze aminierter Verbindungen vorliegen, den Nachteilen des Standes der Technik abhelfen.

Zwar beschreibt die Europäische Patentanmeldungsschrift EP-0 036 134 desodorierende Zusammensetzungen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an Derivaten mittel- bis längerkettiger Alkansäuren, welche auch die Derivate der α,Ω-Alkandicarbonsäuren der allgemeinen Formel

.1

35

umfassen

mit n = 4 bis 10.

Die Derivate im Sinne der EP-Schrift sind unter anderem als Ester, Halbester, Nitrile und Halbnitrile zu verstehen. Ein Hinweis auf die erfindungsgemäße Wirksamkeit der α,Ω-Alkandicarbonsäuren selbst findet sich in dieser Schrift jedoch nicht.

5

20

25

30

35

45

50

Ferner beschreibt die Deutsche Offenlegungsschrift DE-OS 27 03 642 desodorierende Mittel für die Körperhygiene, enthaltend eine Mischung aus einer oder mehreren der α,Ω -Alkandicarbonsäuren Malonsäure, Bernsteinsäure, Glutarsäure und Adipinsäure, wobei Bernsteinsäure und Adipinsäure ausdrücklich benannt sind sowie einem Salz aus einer solchen α,Ω -Alkandicarbonsäure und einer aminierten Verbindung.

Ein Hinweis auf die hiermit vorgelegte Lehre findet sich jedoch auch in dieser Schrift nicht.

Erfindungsgemäß werden die α , Ω -Alkandicarbonsäuren bevorzugt gewählt aus der Gruppe der Substanzen, die von der generischen Formel

о С-(СН₂)_п-С Н-О

beschrieben werden, wobei n Zahlen von 1 bis 8 annehmen kann.

n = 1 : Malonsäure

n = 2 : Bernsteinsäure

n = 3: Glutarsäure

n = 4 : Adipinsäure

n = 5: Pimelinsäure

n = 6 : Korksäure n = 7 : Azelainsäure

n = 8 : Sebacinsäure

Erfindungsgemäß ist ferner ein Verfahren zur Bekämpfung des durch mikrobielle Zersetzung apokrinen Schweißes hervorgerufenen menschlichen Körpergeruches, dadurch gekennzeichnet, daß eine wirksame Menge an α,Ω -Alkandicarbonsäuren, welche gegebenenfalls in einem geeigneten kosmetischen Träger vorliegen können, auf die Haut aufgetragen wird.

Es ist ferner gegebenenfalls vorteilhaft, wenn die erfindungsgemäßen α,Ω-Dicarbonsäuren in Form ihrer physiologisch verträglichen "Halbsalze", beispielsweise als Natrium- oder Kaliumhydrogendicarboxylate, vorliegen. Solche "Halbsalze" können durch eine Struktur wie folgt gekennzeichnet sein:

$$C - (CH_2)_n - C_0$$
 $C - (CH_2)_n - C_0$
 $C - (CH_2)_n - C_0$

M+ stellt dabei ein Metallion dar.

Die Existenz solcher "Halbsalze" kann gewährleistet werden durch Pufferung der erfindungsgemäßen α,Ω-Alkandicarbonsäuren mit geeigneten Alkalien, vorzugsweise im PH-Bereich von ca. 4 bis 6,5.

Wenn in dieser Anmeldung von den erfindungsgemäßen α,Ω-Alkandicarbonsäuren die Rede ist, so sind stets die Erscheinungsformen im sauren bis neutralen Bereich gemeint.

Erfindungsgemäß ist schließlich auch die Verwendung von $\alpha.\Omega$ -Alkandicarbonsäuren, welche gegebenenfalls in einem geeigneten kosmetischen Träger vorliegen können, zur Bekämpfung grampositiver, insbesondere coryneformer Bakterien, beziehungsweise die Verwendung von $\alpha.\Omega$ -Alkandicarbonsäuren, welche gegebenenfalls in einem geeigneten kosmetischen Träger vorliegen können, zur Verhinderung des Wachstums grampositiver, insbesondere coryneformer Bakterien.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen Desodorantien sind besonders vorteilhaft dadurch gekennzeichnet, daß die α,Ω-Alkandicarbonsäuren in Konzentrationen von 0,05–10 Gew.-%, bevorzugt 0,1–5 Gew.-%, vorliegen, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen Desodorantien können in Form von Aerosolen, also aus Aerosolbehältern, Quetschflaschen oder durch eine Pumpvorrichtung versprühbaren Präparaten vorliegen oder in Form von

mittels Roll-on-Vorrichtungen auftragbaren flüssigen Zusammensetzungen, als Deo-Stifte (Deo-Sticks) und in Form von aus normalen Flaschen und Behältern auftragbaren W/O- oder O/W-Emulsionen, z. B. Cremes oder Lotionen. Weiterhin können die kosmetischen Desodorantien vorteilhaft in Form von desodorierenden Tinkturen, desodorierenden Intimreinigungsmitteln, desodorierenden Shampoos, desodorierenden Dusch- oder Badezubereitungen oder desodorierenden Pudern hergestellt werden.

Als übliche kosmetische Trägerstoffe zur Herstellung der erfindungsgemäßen desodorierenden Zubereitungen können neben Wasser, Ethanol und Isopropanol, Glycerin und Propylenglykol hautpflegende Fett- oder fettähnliche Stoffe, wie Ölsäuredecylester, Cetylalkohol, Cetylstearylalkohol und 2-Octyldodecanol, in den für solche Präparate üblichen Mengenverhältnissen eingesetzt werden sowie schleimbildende Stoffe und Verdikkungsmittel, z. B. Hydroxyethyl- oder Hydroxypropylcellulose, Polyvinylpyrrolidon, daneben aber auch in kleinen Mengen cyclische Silikonöle (Polydimethylsiloxane) sowie flüssige Polymethylphenylsiloxane niedriger Viskosität.

Als Treibmittel für erfindungsgemäße, aus Aerosolbehältern versprühbare kosmetische Desodorantien sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, beispielsweise Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden.

Natürlich weiß der Fachmann, daß es an sich nichttoxische Treibgase gibt, die grundsätzlich für die vorliegende Erfindung geeignet wären, auf die aber dennoch wegen bedenklicher Wirkung auf die Umwelt oder sonstiger Begleitumstände verzichtet werden sollte, insbesondere Fluorchlorkohlenwasserstoffe (FCKW).

Als Emulgatoren zur Herstellung der erfindungsgemäßen kosmetischen Desodorantien, welche vorteilhaft als flüssige Zubereitungen mittels einer Roll-on-Vorrichtung auf die gewünschten Hautbereiche aufgetragen werden sollen, und die in den Zubereitungen in geringer Menge, z. B. 2 bis 5 Gewichts.-%, bezogen auf die Gesamtzusammensetzung, verwendet werden können, haben sich nichtionogene Typen, wie Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z. B. Cetostearylalkoholpolyethylenglykolether mit 12 bzw. 20 angelagerten Ethylenoxid-Einheiten pro Molekül, Cetostearylalkohol sowie Sorbitanester und Sorbitanester-Ethylenoxid-Verbindungen (z. B. Sorbitanmonostearat und Polyoxyethylensorbitanmonostearat) und langkettige höhermolekulare wachsartige Polyglykolether als geeignet erwiesen.

Zusätzlich zu den genannten Bestandteilen können den erfindungsgemäßen desodorierenden kosmetischen Zubereitungen Parfüm, Farbstoffe, Antioxidantien (z. B. α-Tocopherol und seine Derivate oder Butylhydroxytoluol (BHT = 2,6-Di-Tert.-butyl-4-methylphenol) in Mengen von 0,01 bis 0,03%, bezogen auf die Gesamtzusammensetzung), Suspendiermittel, Puffergemische oder andere übliche kosmetische Grundstoffe beigemischt werden.

Die jeweils einzusetzenden Mengen an kosmetischen Trägerstoffen und Parfüm können in Abhängigkeit von der Art des jeweiligen Produktes vom Fachmann durch einfaches Ausprobieren leicht ermittelt werden.

Zur Parfümierung sind gegebenenfalls auch solche Substanzen und Parfümöle geeignet, die stabil sind, die Haut nicht reizen und bereits als solche antibakterielle oder bakteriostatische Eigenschaften besitzen.

Die Herstellung der kosmetischen Zubereitungen erfolgt, abgesehen von speziellen Zubereitungen, die in den Beispielen jeweils gesondert vermerkt sind, in üblicher Weise, zumeist durch einfaches Vermischen unter Rühren, gegebenenfalls unter leichter Erwärmung. Sie bietet keine Schwierigkeiten. Für Emulsionen werden Fettphase und die Wasserphase z. B. separat, gegebenenfalls unter Erwärmen hergestellt und dann emulgiert.

Ansonsten sind die üblichen Maßregeln für das Zusammenstellen von kosmetischen Formulierungen zu beachten, die dem Fachmann geläufig sind.

Es folgen vorteilhafte Ausführungsbeispiele der vorliegenden Erfindung. Die angegebenen Zahlenwerte beziehen sich stets auf Gew.-%, sofern nicht ausdrücklich etwas anderes vermerkt wird.

4

45

50

55

60

Beispiel 1-3

Pumpspray	1	2	3	
				5
a) .			•	
Ethanol	60,0	65,0	55,0	.10
Glycerin	3,0	3,0	2,0	
PEG-40-hydriertes				
Rizinusöl	2,2	2,5	1,5	15
Bernsteinsäure	_	-	1,2	
Adipinsäure	0,9	. -	-	
Azelainsäure	-	0,8	- .	20
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	
				25
b) .			•	25
Wasser				30
NaOH 10 %ig		• .		30
ad pH 5	jew	eils ad 100,	0	<i>3</i> "

Die unter (a) genannten Bestandteile werden zu einer homogenen Lösung verarbeitet, sodann langsam mit der Wasserphase (b) aufgefüllt. Der fertige Pumpspray kann sodann in Pumpzerstäuber abgefüllt werden.

Beispiel 4-6

5	Roll-on-Gel	4	5	6
	a) ·			
10	Ethanol Hydroxyethyl-	55,0	55,0	45,0
15	Cellulose Steareth 20	0,5	0,5	0,5
	("Brij ^R 78")	1,0	1,0	0,5
20	Bernsteinsäure	-	_	1,4
20	Adipinsäure	-	0,9	
	Azelainsäure	0,9	-	-
25	Parfum	q.s.	q.s.	q.s.
	b)			
30	Wasser NaOH 10 %ig			
35	ad pH 5	je	veils ad 10	0,0

Die Bestandteile werden mit der zuvor auf einen pH von ca. 5 berechneten Menge an NaOH-Lösung zusammengegeben. Die entstandene Mischung wird homogenisiert und kann abgefüllt werden.

55

50

40

45

60

Beispiel 7-9

Roll-on-Emulsion	7	8	9	
				5
Steareth-10				
("Brij ^R 76")	4,0	4,0	4,0	
Cetylalkohol	2,0	1,8	1,5	10
Mineralöl (DAB 9)	8,0	8,0	8,0	
PPG-15-Stearylether	5,0	5;0	5,0	
Methylparaben	0,2	0,2	0,2	15
Adipinsäure	1,1	-	-	
Azelainsäure	-	1,0	1,3	
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	20
b)				
				25
Wasser				
NaOH 10 %ig				
ad pH 5	je	weils ad 1	00,0	30

Die Bestandteile werden mit der zuvor auf einen pH von ca. 5 berechneten Menge an NaOH-Lösung zusammengegeben. Die entstandene Mischung wird homogenisiert und kann abgefüllt werden.

Beispiel 10-11

Wachsstift (wasserfrei, seifenfrei)	11	12	40
Trilaurin	38,0	38,0	
Caprylic/capric Triglyceride			45
("Miglyol ^R 812")	30,0	30,0	
Steareth-10	9,0	9,0	
Bienenwachs	21,0	21,0	50
Adipinsäure	0,8	-	
Azelainsäure	-	0,9	
Parfum	1,2	1,1	55

60

65

Die Bestandteile werden bei ca. 75° C aufgeschmolzen, gut vermischt und in geeignete Formen gegossen.

Patentansprüche

1. Kosmetische Desodorantien, enthaltend eine oder mehrere $\alpha\Omega$ -Alkandicarbonsäuren, wobei die $\alpha\Omega$ -Alkandicarbonsäure oder die $\alpha\Omega$ -Alkandicarbonsäuren nicht in Form der Salze aminierter Verbindungen vorliegen.

2. Kosmetische Desodorantien nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die $\alpha \Omega$ -Alkandicarbonsäuren gewählt werden aus der Gruppe

Malonsäure, Bernsteinsäure, Glutarsäure, Adipinsäure, Pimelinsäure, Korksäure, Azelainsäure, Sebacinsäu-

7

;:

re.

3. Kosmetische Desodorantien nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die α , Ω -Alkandicarbonsäuren in Konzentrationen von 0,05–10 Gew.-%, bevorzugt 0,1–5 Gew.-%, vorliegen, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

4. Kosmetische Desodorantien nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß sie in Form von

- Aerosolen, also aus Aerosolbehältern, Quetschflaschen oder durch eine Pumpvorrichtung versprühbaren Präparaten
- mittels Roll-on-Vorrichtungen auftragbaren flüssigen Zusammensetzungen,

- Deo-Stiften (Deo-Sticks)

- aus normalen Flaschen und Behältern auftragbaren W/O- oder O/W-Emulsionen, z. B. Cremes oder Lotionen
- desodorierenden Tinkturen,
- desodorierenden Intimreinigungsmitteln,

- desodorierenden Shampoos,

- desodorierenden Dusch- oder Badezubereitungen oder

- desodorierenden Pudern vorliegen.

- 5. Verwendung von $\alpha\Omega$ -Alkandicarbonsäuren als desodorierend wirkendes Prinzip für kosmetische Desodorantien.
- 6. Verwendung von α , Ω -Alkandicarbonsäuren zur Bekämpfung grampositiver, insbesondere coryneformer Bakterien oder zur Verhinderung deren Wachstums.
- 7. Verfahren zur Bekämpfung des durch mikrobielle Zersetzung apokrinen Schweißes hervorgerufenen menschlichen Körpergeruches, dadurch gekennzeichnet, daß eine wirksame Menge an α,Ω -Alkandicarbonsäuren welche gegebenenfalls in einem geeigneten kosmetischen Träger vorliegen können, auf die Haut aufgetragen wird.

25

30

35

40

45

50

55

60

65

1

5

10

15

20